## (12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

## (19) World Intellectual Property Organization International Bureau



## . | (1888) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1884) | 1886) | 1886) | 1886) | 1886) | 1886) | 1886) | 1886) | 1886) | 1886) | 1886) | 1886) | 18

(43) International Publication Date 15 July 2004 (15.07.2004)

**PCT** 

## (10) International Publication Number WO 2004/058750 A1

- (51) International Patent Classification?: C07D 417/04, 417/14, 487/04, A61K 31/427, A61P 35/00 // (C07D 487/04, 253:00, 231:00)
- (21) International Application Number:

PCT/GB2003/005651

(22) International Filing Date:

24 December 2003 (24.12.2003)

(25) Filing Language:

English

(26) Publication Language:

English

(30) Priority Data:

0230162.0

24 December 2002 (24.12.2002) GB

- (71) Applicant (for all designated States except US): METRIS THERAPEUTICS LIMITED [GB/GB]; 400 Thames Valley Park Drive, Reading RG6 1PT (GB).
- (72) Inventors; and
- (75) Inventors/Applicants (for US only): KNOX, Peter

[GB/GB]; 400 Thames Valley Park Drive, Reading RG6 1PT (GB). O'SULLIVAN, Michele [GB/GB]; 400 Thames Valley Park Drive, Reading RG6 1PT (GB). LENTFER, Heike [GB/GB]; 400 Thames Valley Park Drive, Reading RG6 1PT (GB).

- (74) Agents: GOODFELLOW, Hugh, Robin et al.; Carpmaels & Ransford, 43-45 Bloomsbury Square, London WC1A 2RA (GB).
- (81) Designated States (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) Designated States (regional): ARIPO patent (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Eurasian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE,

[Continued on next page]

(54) Title: PIPERIDINYL-THIAZOLE CARBOXYLIC ACID DERIVATIVES AS ANGIOGENESIS INHIBITORS

(57) Abstract: This invention relates to compounds of formula (I) and (II) that are useful in treating vascular endothelial growth factor (VEGF)-mediated disorders, particularly endometriosis and acute macular degenerative disorder. The invention also relates to a topical system for the treatment of acute macular degenerative disorder comprising a VEGF inhibitor.